

## BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND



EP 03/12774  
Rec'd PCT/PTO 21 APR 2005  
REC'D 19 FEB 2004  
WIPO PCT

Prioritätsbescheinigung über die Einreichung  
einer Patentanmeldung

**Aktenzeichen:** 102 57 394.8

**Anmeldetag:** 06. Dezember 2002

**Anmelder/Inhaber:** BASF Aktiengesellschaft, Ludwigshafen/DE

**Bezeichnung:** 2-Substituierte Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

**IPC:** C 07 D, A 01 N

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.

München, den 25. Juni 2003  
Deutsches Patent- und Markenamt  
Der Präsident  
Im Auftrag

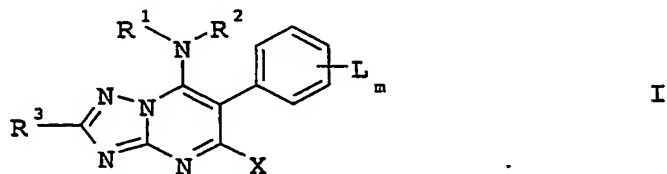
Dzierzen

**PRIORITY  
DOCUMENT**

SUBMITTED OR TRANSMITTED IN  
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

## Patentansprüche

## 1. 2-Substituierte Triazolopyrimidine der Formel I



10 in die Substituenten folgende Bedeutung haben:

15 L unabhängig voneinander Halogen, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, -C(=O)-A oder S(=O)<sub>n</sub>A';

20 A Wasserstoff, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino oder Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl)amino;

A' Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl;

n 0, 1 oder 2;

25 m 0 oder 1, 2, 3, 4 oder 5;

X Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy;

30 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenacycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>-Alkadienyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkynyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkynyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

40 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein und/oder einen oder

mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann oder in dem ein N- und ein benachbartes C-Atom durch eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylenkette verbunden sein können;

wobei R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R<sup>a</sup> substituiert sein kann:

R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R<sup>b</sup> tragen können:

R<sup>b</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthal-

3

ten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können; und

5

R<sup>3</sup> Cyano, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyloxy oder NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>.

10

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Halogen bedeutet.

3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> folgende Bedeutung haben:

15

R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogen-cycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl; und

20

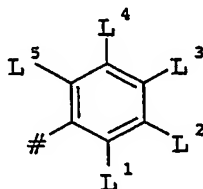
R<sup>2</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl; oder

25

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten oder ungesättigten Ring bilden, der einen oder zwei Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl tragen kann;

30

4. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, in der die durch L<sub>n</sub> substituierte Phenylgruppe für die Gruppe A



35

steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst ist und

40

L<sup>1</sup> Fluor, Chlor, CH<sub>3</sub> oder CF<sub>3</sub>;

L<sup>2</sup>, L<sup>4</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff oder Fluor;

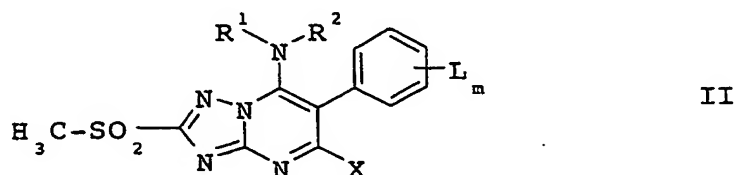
L<sup>3</sup> Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano, CH<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> oder COOCH<sub>3</sub> und

L<sup>5</sup> Wasserstoff, Fluor oder CH<sub>3</sub> bedeuten.

45

4

5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 durch Umsetzung von Sulfonen der Formel II,

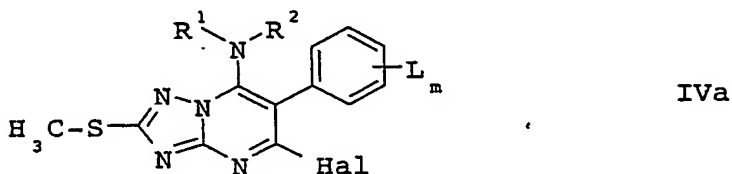


mit Verbindungen der Formel III,



15 in der M für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium-, Alkali- oder Erdalkalimetallkation steht und  $R^3$  die für Formel I gegebene Bedeutung hat, unter basischen Bedingungen.

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Cyano, Alkoxy oder Halogenalkoxy steht, durch Umsetzung von Verbindungen der Formel IVa

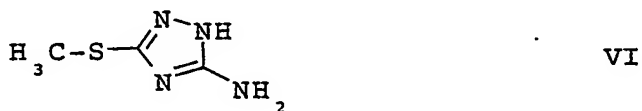


25 mit Verbindungen  $M-X'$



30 wobei M in Formel V für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetall steht zu Verbindungen der Formel IVb und Oxidation von IVb zu Sulfonen der Formel II gemäß Anspruch 5, in denen X für  $X'$  steht und Umsetzung der Sulfone mit Verbindungen der Formel III gemäß Anspruch 5.

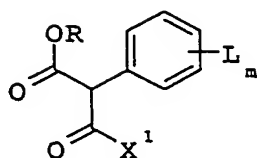
- 35 7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl steht, durch Umsetzung von Triazolen der Formel VI



mit Dicarbonylverbindungen der Formel VII,

45

5

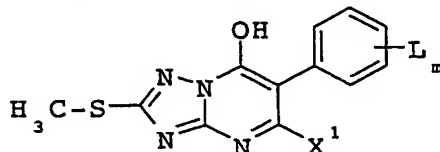


VII

5

in der R und X<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl stehen zu Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel VIII,

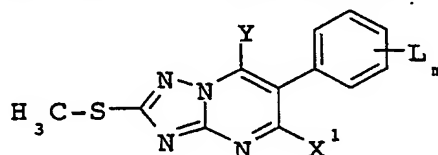
10



VIII

Halogenierung von VIII zu Verbindungen der Formel IX

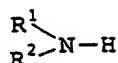
15



IX

20

in der Y für Halogen, insbesondere Chlor oder Brom steht, Umsetzung von IX mit Aminen der Formel VI,

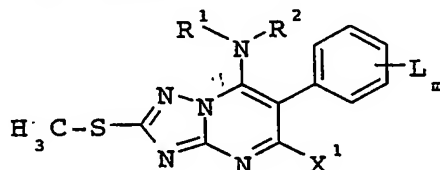


X

25

in der R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben, zu Verbindungen der Formel IVc,

30



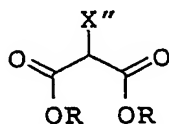
IVc

35

Oxidation von IVc zu Sulfonen der Formel II gemäß Anspruch 5, in der X für X<sup>1</sup> steht und Umsetzung der Sulfone mit Verbindungen der Formel III gemäß Anspruch 5.

8. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht, durch Umsetzung von Verbindungen IVa gemäß Anspruch 6 und Malonaten der Formel XI,

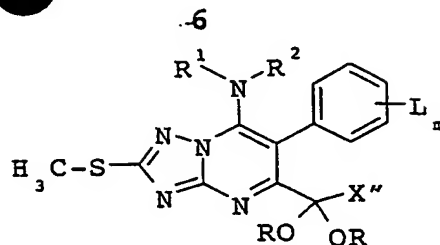
40



XI

45

in der X'' Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl und R C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeuten, zu Verbindungen der Formel XII



und Verseifung des Esters XII und Decarboxylierung zu Verbindungen der Formel IVc gemäß Anspruch 7, in der X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht, Oxidation von IVc zu Sulfonen der Formel II gemäß Anspruch 5, in der X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht und Umsetzung der Sulfone mit Verbindungen der Formel III gemäß Anspruch 5.

9. Zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.

10. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

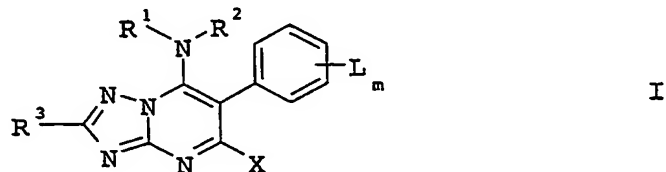
2-Substituierte Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

5

## Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft 2-substituierte Triazolopyrimidine der Formel I,

10



15

in die Substituenten folgende Bedeutung haben:

L unabhängig voneinander Halogen, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkinyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, -C(=O)-A oder S(=O)<sub>n</sub>A';

20

A Wasserstoff, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino oder Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl)amino;

25

A' Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl;

30

n 0, 1 oder 2;

m

0 oder 1, 2, 3, 4 oder 5;

X

Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy;

35

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>-Alkadienyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkynyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkynyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

40

45



## 2

5 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann oder in dem ein N- und ein benachbartes C-Atom durch eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylenkette verbunden sein können;

10 wobei R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R<sup>a</sup> substituiert sein kann:

15 R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

20 wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R<sup>b</sup> tragen können:

30 R<sup>b</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

40 und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

45 Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vor-

zugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5  
oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen  
Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder  
durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert  
sein können; und

R<sup>3</sup> Cyano, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halo-  
genalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyloxy oder NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>.

10 Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte  
zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie  
ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpil-  
zen.

15 Aus EP-A 71 792 und EP-A 550 113 sind 6-Phenyl-7-amino-triazolo-  
pyrimidine allgemein bekannt. In 2-Stellung substituierte Triazo-  
lopyrimidine sind aus EP-A 71 792, EP-A 141 317, WO 02/88126 und  
WO 02/88127 bekannt. Die in den genannten Schriften beschriebenen  
Verbindungen sind zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignet.

20 Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend.  
Davon ausgehend, liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zu-  
grunde, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbrei-  
tertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

25 Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden.  
Desweiteren wurden Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Her-  
stellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung  
von pflanzenpathogenen Schadpilzen unter Verwendung der

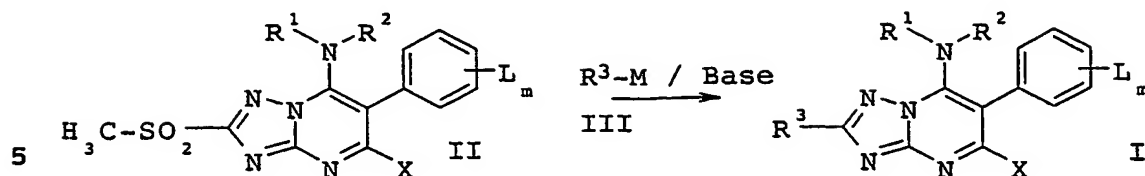
30 Verbindungen I gefunden.

Die Verbindungen der Formel I unterscheiden sich von den aus den  
oben genannten Schriften durch den Substituenten in der 2-Posi-  
tion.

35 Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten  
Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen pflanzenpathogene Schad-  
pilze auf.

40 Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen  
erhalten werden. Vorteilhaft werden sie durch Umsetzung von Sul-  
fonen der Formel II unter basischen Bedingungen mit Verbindungen  
der Formel III erhalten. Verbindungen III stellen je nach Ausge-  
staltung der Gruppe R<sup>3</sup> Cyanide, Hydroxide, Alkoholate oder Amine  
45 dar. Das Kation M in Formel III hat geringe Bedeutung; aus prak-  
tischen Gründen sind üblicherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium-  
oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt.

4



Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von -20°C bis 120°C, vorzugsweise 0°C bis 25°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. Heteroat. Chem. S.313 10 (2000)].

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische oder aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile, Ketone, Alkohole sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt Dimethylsulfoxid, Dioxan und Benzol. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

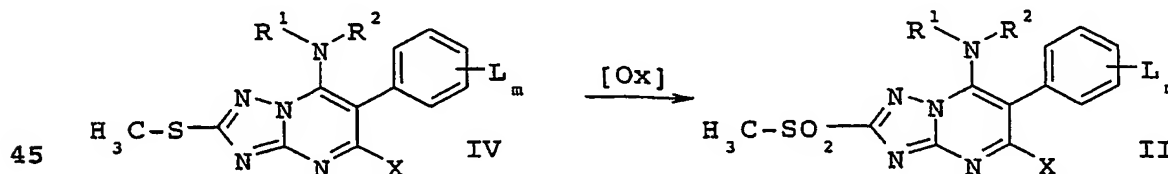
20

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt wird Natriumhydrid. Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

30 Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, III in einem Überschuß bezogen auf II einzusetzen.

Die Sulfone der Formel II, in der X Halogen bedeutet, sind an  
35 sich aus WO 02/88127 bekannt.

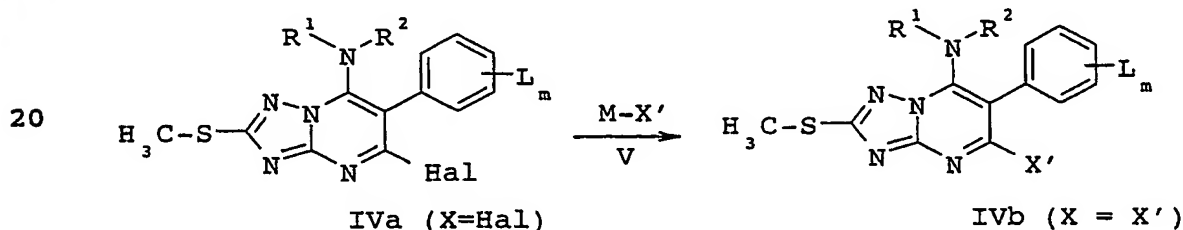
Sulfone der Formel II werden durch Oxidation der entsprechenden Thiomethylverbindungen IV erhalten. In Formel IV haben die Variablen die Bedeutung wie in Formel I. Ihre Herstellung erfolgt unter den aus WO 02/88127 bekannten Bedingungen.



## 5

Thiomethylverbindungen der Formel IV, in der X Halogen bedeutet, sind an sich aus WO 02/88127 bekannt. Thiomethylverbindungen der Formel IV, in der X für Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy oder Halogenalkoxy steht, sind vorteilhaft auf den im Folgenden skizzierten Wegen erhältlich:

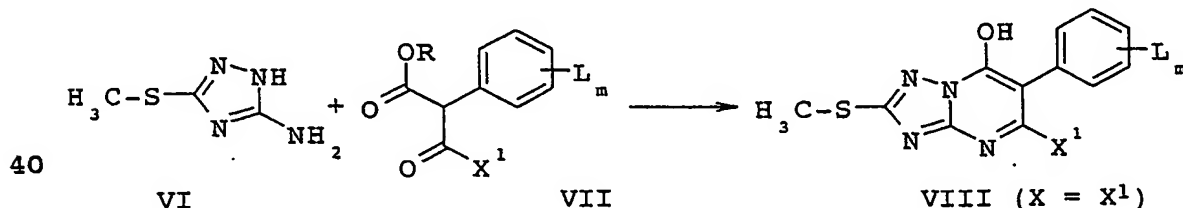
2-Thiomethyltriazolopyrimidine der Formel IV, in der Hal für ein Halogenatom (Formel IVa), bevorzugt für Chlor steht, werden mit Verbindungen M-X' (Formel V) zu Verbindungen der Formel IVb umgesetzt. Verbindungen V stellen je nach der Bedeutung der einzuführenden Gruppe X' ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxylat oder ein Halogenalkoxylat dar. Die Umsetzung erfolgt vorteilhaft in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels. Das Kation M in Formel V hat geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind üblicherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt.



Üblicherweise liegt dabei die Reaktionstemperatur bei 0 bis 120°C, bevorzugt bei 10 bis 40°C [vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd.12, S. 861-863 (1975)].

Geeignete Lösungsmittel umfassen Ether, wie Dioxan, Diethylether und, bevorzugt Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichloromethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol.

Verbindungen der Formel IV, in denen X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl steht (Formel IVc), können vorteilhaft durch folgenden Syntheseweg erhalten werden:



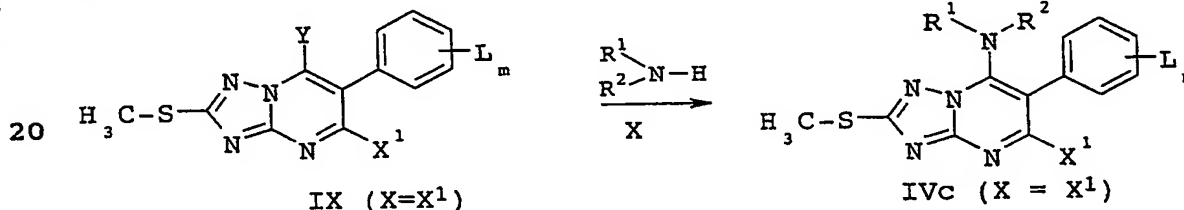
Ausgehend von den Diketonen VII werden die 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine VIII erhalten. In Formel VII steht X<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl. Durch Verwendung der leicht zugänglichen 2-Phenylacetessigester (V mit X<sup>1</sup>=CH<sub>3</sub>) werden die 5-Methyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine erhalten [vgl. Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. Die Herstellung der

## 6

Ausgangsverbindungen V erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10 02 788 beschriebenen Bedingungen.

Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine 5 werden mit Halogenierungsmitteln zu den 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel IX umgesetzt. Bevorzugt werden Chlorierungs- oder Bromierungsmittel wie Phosphoroxybromid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Sulfurylchlorid eingesetzt. Die Umsetzung kann in Substanz oder in Gegenwart eines Lösungs- 10 mittels durchgeführt werden. Übliche Reaktionstemperaturen betragen von 0 bis 150°C oder vorzugsweise von 80 bis 125°C [vgl. EP-A 770 615].

Die 5-Alkyl-7-halogen-6-phenyltriazolopyrimidine der Formel IX 15 werden mit Aminen der Formel X, in der R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> wie in Formel I definiert sind, zu Verbindungen der Formel IVc weiter umgesetzt.



Diese Umsetzung wird vorteilhaft bei 0°C bis 70°C, bevorzugt 10°C 25 bis 35°C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichloromethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Toluol [vgl. WO 98/46608].

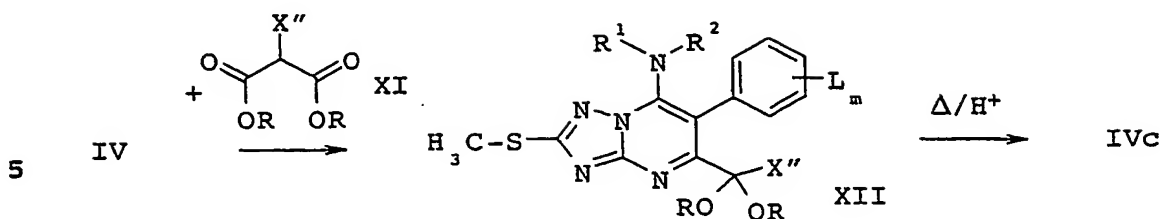
30

Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder anorganische Amine, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssiges Amin der Formel X kann als Base dienen.

35

Verbindungen der Formel IVc können alternativ auch aus Verbindungen IVa, in der X insbesondere Chlor bedeutet, und Malonaten der Formel XI hergestellt werden. In Formel XI bedeuten X" Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl und R C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl. Sie werden zu Verbindungen der Formel XII umgesetzt und zu Verbindungen IV decarboxyliert [vgl. US 5,994,360]. 40

7



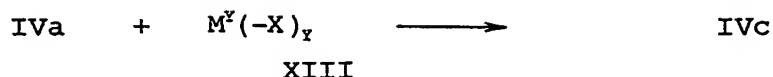
Die Malonate XI sind in der Literatur bekannt [J. Am. Chem. Soc., Bd. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974); Helv. 10 Chim. Acta, Bd. 61, 1565 (1978)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

Die anschließende Verseifung des Esters XII erfolgt unter allgemein üblichen Bedingungen, in Abhängigkeit der verschiedenen 15 Strukturelemente kann die alkalische oder die saure Verseifung der Verbindungen XII vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu IVc bereits ganz oder teilweise erfolgen.

20 Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise 50°C bis 120°C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure.

Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, 25 Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Di- 30 ethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propa- 35 nol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

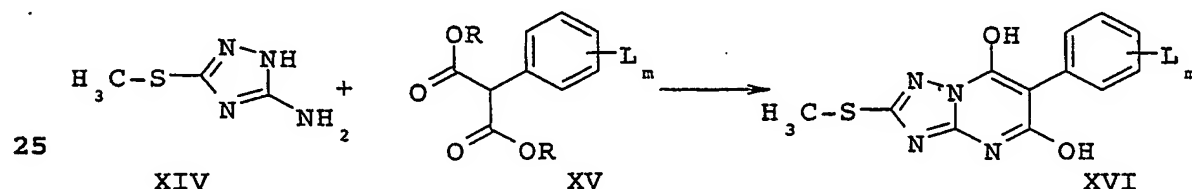
40 Verbindungen der Formel IVc können auch durch Kupplung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel IVa mit metallorganischen Reagenzien der Formel XIII, in der X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl steht, erhalten werden. In einer Ausführungsform dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse. 45



5 In Formel XIII steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, 358  
10 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

Ein besonders vorteilhafter Zugang zu den Zwischenprodukten der Formel IVa besteht in den folgenden Routen:

15 Ausgehend von 3-Thiomethyl-5-aminotriazol der Formel XIV werden mit entsprechend substituierten Phenylmalonaten der Formel XV, in der R für Alkyl, bevorzugt für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl steht, die Dihydroxytriazolopyrimidine XVI dargestellt.  
20 stellt.



Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 80°C bis 250°C, vorzugsweise 120°C bis 180°C, ohne Solvens oder in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A 770 615] oder in Gegenwart von Essigsäure unter den aus Adv. Het. Chem. Bd. 57, S. 81ff. (1993) bekannten Bedingungen.  
30

35 Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether, Nitrile, Ketone, Alkohole, sowie N-Methylpyrrolidon, Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid. Besonders bevorzugt wird die Umsetzung  
40 ohne Lösungsmittel oder in Chlorbenzol, Xylol, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Basen kommen insbesondere organische Basen, z.B. tertiäre  
45 Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin, Tributylamin und N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylamino-

9

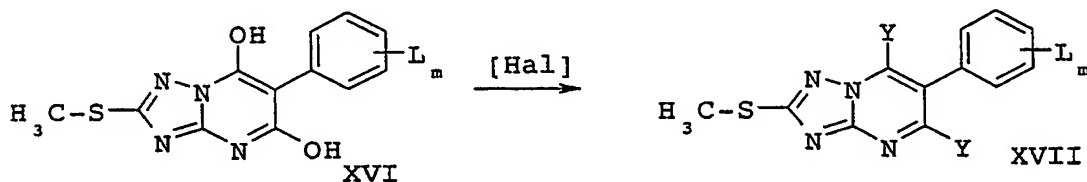
pyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden tertiäre Amine wie Tri-isopropylethylamin, Tributylamin, N-Methylmorpholin oder N-Methylpiperidin. Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber  
5 auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, die  
10 Base und das Malonat XV in einem Überschuß bezogen auf das Triazol XIV einzusetzen.

3-Thiomethyl-5-aminotriazol der Formel XIV ist kommerziell erhältlich. Phenylmalonate der Formel XV werden vorteilhaft aus der  
15 Reaktion entsprechend substituierter Brombenzole mit Dialkylmalonaten unter Cu(I)-Katalyse erhalten [vgl. Chemistry Letters, S. 367-370 (1981); EP-A 10 02 788].

Die Dihydroxytriazolopyrimidine der Formel XVI werden unter den  
20 aus WO 94/20501 bekannten Bedingungen in die Dihalogenpyrimidine der Formel XVII überführt. Als Halogenierungsmittel wird vorteilhaft ein Chlorierungsmittel oder ein Bromierungsmittel, wie Phosphoroxybromid oder Phosphoroxychlorid, ggf. in Anwesenheit eines Lösungsmittels, eingesetzt.

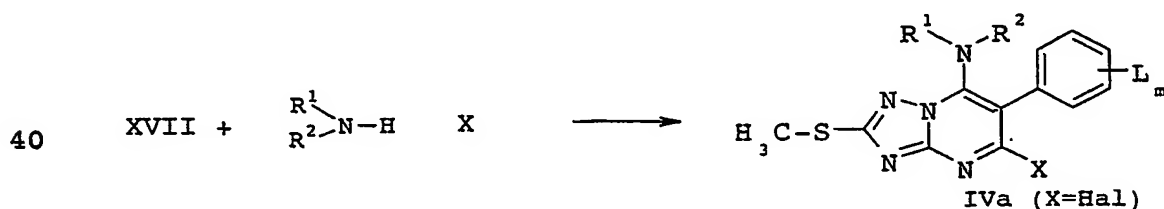
25



30

Diese Umsetzung wird üblicherweise bei 0°C bis 150°C, bevorzugt bei 80°C bis 125°C, durchgeführt [vgl. EP-A 770 615].

Dihalogenpyrimidine der Formel XVII werden mit Aminen der Formel  
35 X zu Verbindungen der Formel IVa weiter umgesetzt.



40

Verbindungen der Formel IVa sind z. T. aus WO 02/88127 bekannt.

45



Sofern R<sup>1</sup> oder R<sup>2</sup> Halogenalkyl oder Halogenalkenylgruppen beinhalten ist für optisch aktive Amine der Formel X die (S)-Konfiguration bevorzugt.

5 Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig  
10 erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

15 Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich  
20 die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der  
25 Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz erfolgen.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:  
30

**Halogen:** Fluor, Chlor, Brom und Jod;

**Alkyl:** gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen, z.B.  
35 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl,  
40 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

**Halogenalkyl:** geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B.

- 5 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-10 2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

**Alkenyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer

- 15 Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 20 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 25 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 30 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 35 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

40

**Alkadienyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und zwei Doppelbindungen in beliebiger Position;

- 45 **Halogenalkenyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt),

wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

- 5 Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl wie Ethynyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl,
- 10 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl,
- 15 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;
- 20 Cycloalkyl: mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;
- 25 Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>O, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O;
- 30 fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S:
- 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder
- 35 ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuran-1-yl, 3-Tetrahydrofuran-1-yl, 2-Tetrahydrothien-1-yl, 3-Tetrahydrothien-1-yl, 2-Pyrrolidin-1-yl, 3-Pyrrolidin-1-yl, 3-Isoxazolidin-1-yl, 4-Isoxazolidin-1-yl, 5-Isoxazolidin-1-yl, 3-Isothiazolidin-1-yl, 4-Isothiazolidin-1-yl, 5-Isothiazolidin-1-yl, 3-Pyrazolidin-1-yl,
- 40 4-Pyrazolidin-1-yl, 5-Pyrazolidin-1-yl, 2-Oxazolidin-1-yl, 4-Oxazolidin-1-yl, 5-Oxazolidin-1-yl, 2-Thiazolidin-1-yl, 4-Thiazolidin-1-yl, 5-Thiazolidin-1-yl, 2-Imidazolidin-1-yl, 4-Imidazolidin-1-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl,
- 45 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-3-yl, 2,4-Dihydrofuran-2-yl, 2,4-Dihydrofuran-3-yl, 2,3-Dihy-

- drothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isoxazolin-3-yl, 3-Isoxazolin-3-yl, 4-Isoxazolin-3-yl, 2-Isoxazolin-4-yl, 3-Isoxazolin-4-yl, 4-Isoxazolin-4-yl, 2-Isoxazolin-5-yl, 3-Isoxazolin-5-yl, 4-Isoxazolin-5-yl, 2-Isythiazolin-3-yl, 3-Isythiazolin-3-yl, 4-Isythiazolin-3-yl, 2-Isythiazolin-4-yl, 3-Isythiazolin-4-yl, 4-Isythiazolin-4-yl, 2-Isythiazolin-5-yl, 3-Isythiazolin-5-yl, 4-Isythiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydro-triazin-2-yl und 1,2,4-Hexahydro-triazin-3-yl;
- 25 - 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isythiazolyl, 4-Isythiazolyl, 5-Isythiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl,
- 30 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;
- 35 - 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;
- 40 45

14

**Alkylen:** divalente unverzweigte Ketten aus 3 bis 5 CH<sub>2</sub>-Gruppen, z.B. CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> und CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;

**Oxyalkylen:** divalente unverzweigte Ketten aus 2 bis 4 CH<sub>2</sub>-Gruppen, 5 wobei eine Valenz über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;

**Oxyalkylenoxy:** divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das 10 Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>O, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O.

In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Razemate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.

15

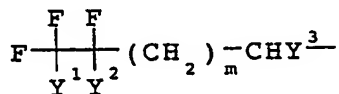
Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste L<sub>n</sub>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und X der Formel I.

20 Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

25 Verbindungen I werden bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl steht.

Verbindungen I sind besonders bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für eine Gruppe B steht

30



B

worin

- 35 Y<sup>1</sup> Wasserstoff, Fluor oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Fluoroalkyl,  
Y<sup>2</sup> Wasserstoff oder Fluor, oder  
Y<sup>1</sup> und Y<sup>2</sup> bilden gemeinsam eine Doppelbindung;  
m is 0 oder 1; und  
Y<sup>3</sup> Wasserstoff oder Methyl bedeuten.

40

Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl steht, welches durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann.

45 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>2</sup> Wasserstoff bedeutet.

## 15

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>2</sup> für Methyl oder Ethyl steht.

Sofern R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> Halogenalkyl oder Halogenalkenylgruppen mit  
5 Chiralitätszentrum beinhalten, sind die (S)-Isomere bevorzugt.

Sofern R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> Alkyl-, Alkenyl- oder Alkinygruppen mit  
Chiralitätszentrum beinhalten, sind die (R)-Isomere bevorzugt.

- 10 Weiterhin werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl,  
15 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann oder in dem ein N- und ein benachbartes C-Atom durch eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylenkette verbunden sein können.

- Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf-  
20 oder sechsgliedrigen Ring bilden, der ggf. eine Doppelbindung aufweisen kann und wie voranstehend beschrieben substituiert sein kann.

- 25 Insbesondere werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Piperidinyl-, Morpholinyl- oder Thiomorpholinylring, insbesondere einen Piperidinylring bilden, der ggf. durch eine bis drei Gruppen Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl,  
30 insbesondere durch 4-Methyl substituiert ist.

- Weiterhin besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Pyrrolidinring bilden, der ggf. durch eine oder zwei Gruppen  
35 Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, insbesondere durch 2-Methyl substituiert ist.

- Verbindungen I sind bevorzugt, in denen R<sup>3</sup> für Hydroxy, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> steht.

40

Bevorzugt werden Verbindungen I, in denen mindestens eine Gruppe L orthoständig zu der Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst steht; insbesondere solche, in denen m den Wert 1, 2 oder 3 aufweist.

45

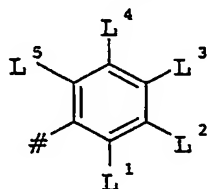
## 16

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen  $L_m$  Halogen, Methyl, Ethyl,  $C_1$ -Halogenalkyl, Methoxy oder  $-C(=O)-A$ , worin A Wasserstoff, Hydroxy,  $C_1-C_4$ -Alkoxy,  $C_1-C_4$ -Halogenalkoxy,  $C_1-C_2$ -Alkylamino oder Di- $(C_1-C_2$ -Alkyl)amino bedeutet.

5

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen die durch  $L_m$  substituierte Phenylgruppe für die Gruppe A

10



A

steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimidin-15 Gerüst ist und

$L^1$  Fluor, Chlor,  $CH_3$  oder  $CF_3$ ;

$L^2, L^4$  unabhängig voneinander Wasserstoff oder Fluor;

$L^3$  Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano,  $CH_3$ ,  $SCH_3$ ,  $SO_2CH_3$ ,  $OCH_3$  oder  $COOCH_3$ ; und

20  $L^5$  Wasserstoff, Fluor oder  $CH_3$  bedeuten.

Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen X Halogen oder  $C_1-C_4$ -Alkyl, wie Chlor oder Methyl, insbesondere Chlor bedeutet.

25

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

30

## Tabelle 1

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Fluor-6-chlor,

35  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 2

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Difluor,  $R^3$

40 Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 3

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Dichlor,  $R^3$

45 Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 4

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Fluor-6-methyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 5

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,4,6-Trifluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 6

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Difluor-4-methoxy,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 7

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  Pentafluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 8

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methyl-4-fluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 9

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Trifluormethyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 10

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methoxy-6-fluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 11

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Chlor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

## Tabelle 12

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Fluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

## Tabelle 13

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,4-Difluor,  $R^3$



Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 14

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Fluor-4-chlor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 15

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Chlor-4-fluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 16

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,3-Difluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 17

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,5-Difluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 18

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,3,4-Trifluor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 19

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 20

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,4-Dimethyl,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 21

- 40 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methyl-4-chlor,  $R^3$  Methoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 22

- 45 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Fluor-4-methyl,

R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 23

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Dimethyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 24

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,4,6-Trimethyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 25

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor-4-cyano, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20 Tabelle 26

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor-4-methyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 27

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 spricht

Tabelle 28

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl-4-fluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und

- 35 R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 29

- Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl-5-fluor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 30

- 45 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl-5-chlor, R<sup>3</sup> Methoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und

R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 31

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor-6-chlor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 32

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 33

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 34

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor-6-methyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 35

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,4,6-Trifluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 36

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor-4-methoxy, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 37

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> Pentafluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 38

- 40 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Methyl-4-fluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 39

- 45 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl,

R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 40

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Methoxy-6-fluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 41

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 42

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 43

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,4-Difluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 44

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor-4-chlor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 45

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor-4-fluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 46

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,3-Difluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 47

- 40 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,5-Difluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 48

- 45 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,3,4-Trifluor, R<sup>3</sup>

Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 49

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 50

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,4-Dimethyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 51

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methyl-4-chlor,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 52

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Fluor-4-methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 53

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Dimethyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 54

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,4,6-Trimethyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 55

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Difluor-4-cyano,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 56

- 40 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Difluor-4-methyl,  $R^3$  Cyano bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45 Tabelle 57

- Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Difluor-4-me-

thoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 58

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl-4-fluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 59

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl-5-fluor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 60

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl-5-chlor, R<sup>3</sup> Cyano bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 61

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor-6-chlor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 62

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 63

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Dichlor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 64

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor-6-methyl, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 65

- 40 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,4,6-Trifluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 66

- 45 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor-4-me-

thoxy, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 67

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> Pentafluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 68

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Methyl-4-fluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 69

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 70

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Methoxy-6-fluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 71

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 72

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 73

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,4-Difluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 74

- 40 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor-4-chlor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 75

- 45 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Chlor-4-fluor,

## 25

R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 76

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,3-Difluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 77

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,5-Difluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 78

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,3,4-Trifluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 79

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Methyl, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 80

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,4-Dimethyl, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 81

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Methyl-4-chlor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 82

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor-4-methyl, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 83

- 40 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Dimethyl, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 84

- 45 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,4,6-Trimethyl,



R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 85

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Di-fluor-4-cyano, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10 Tabelle 86

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Di-fluor-4-methyl, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 87

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

20 entspricht

Tabelle 88

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl-4-fluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 89

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl-5-fluor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 90

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Trifluormethyl-5-chlor, R<sup>3</sup> Dimethylamino bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40 Tabelle 91

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2-Fluor-6-chlor, R<sup>3</sup> Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45 Tabelle 92

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L<sub>m</sub> 2,6-Difluor, R<sup>3</sup>

Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 93

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Dichlor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 94

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Fluor-6-methyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 95

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,4,6-Trifluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 96

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Difluor-4-methoxy,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25 Tabelle 97

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  Pentafluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 Tabelle 98

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methyl-4-fluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35 Tabelle 99

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Trifluormethyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40 Tabelle 100

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methoxy-6-fluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45 Tabelle 101

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Chlor,  $R^3$  Tri-

fluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 102

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Fluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 103

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,4-Difluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 104

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Fluor-4-chlor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 105

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Chlor-4-fluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 106

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,3-Difluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 107

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,5-Difluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 108

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,3,4-Trifluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 109

- 40 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 110

- 45 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,4-Dimethyl,  $R^3$

Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 111

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Methyl-4-chlor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 112

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Fluor-4-methyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 113

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Dimethyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 114

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,4,6-Trimethyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 115

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Difluor-4-cyano,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 Tabelle 116

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Difluor-4-methyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 117

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A

40 entspricht

Tabelle 118

- Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Trifluormethyl-4-fluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
- 45

Tabelle 119

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Trifluormethyl-5-fluor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A 5 entspricht

Tabelle 120

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor,  $L_m$  2-Trifluormethyl-5-chlor,  $R^3$  Trifluormethoxy bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A 10 entspricht

Tabelle A

15	No.	$R^1$	$R^2$
	A-1	H	H
	A-2	$CH_2CH_3$	H
	A-3	$CH_2CH_3$	$CH_3$
	A-4	$CH_2CH_3$	$CH_2CH_3$
20	A-5	$CH_2CF_3$	H
	A-6	$CH_2CF_3$	$CH_3$
	A-7	$CH_2CF_3$	$CH_2CH_3$
	A-8	$CH_2CCl_3$	H
25	A-9	$CH_2CCl_3$	$CH_3$
	A-10	$CH_2CCl_3$	$CH_2CH_3$
	A-11	$CH_2CH_2CH_3$	H
	A-12	$CH_2CH_2CH_3$	$CH_3$
30	A-13	$CH_2CH_2CH_3$	$CH_2CH_3$
	A-14	$CH_2CH_2CH_3$	$CH_2CH_2CH_3$
	A-15	$CH(CH_3)_2$	H
	A-16	$CH(CH_3)_2$	$CH_3$
	A-17	$CH(CH_3)_2$	$CH_2CH_3$
35	A-18	$(\pm) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	H
	A-19	$(\pm) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	$CH_3$
	A-20	$(\pm) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	$CH_2CH_3$
	A-21	$(S) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	H
40	A-22	$(S) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	$CH_3$
	A-23	$(S) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	$CH_2CH_3$
	A-24	$(R) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	H
	A-25	$(R) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	$CH_3$
45	A-26	$(R) CH(CH_3)-CH_2CH_3$	$CH_2CH_3$
	A-27	$(\pm) CH(CH_3)-CH(CH_3)_2$	H
	A-28	$(\pm) CH(CH_3)-CH(CH_3)_2$	$CH_3$

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-29	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-30	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
5 A-31	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-32	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-33	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-34	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
10 A-35	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-36	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-37	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-38	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-39	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
15 A-40	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-41	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-42	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-43	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
20 A-44	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-45	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-46	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-47	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
25 A-48	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-49	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-50	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-51	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-52	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
30 A-53	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-54	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-55	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-56	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
35 A-57	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-58	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-59	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-60	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
40 A-61	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-62	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-63	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-64	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-65	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
45 A-66	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-67	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-68	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-69	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H
5 A-70	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-71	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-72	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H
A-73	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
10 A-74	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-75	CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>	H
A-76	CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-77	CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-78	CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H
15 A-79	CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-80	CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-81	Cyclopentyl	H
A-82	Cyclopentyl	CH <sub>3</sub>
20 A-83	Cyclopentyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-84	Cyclohexyl	H
A-85	Cyclohexyl	CH <sub>3</sub>
A-86	Cyclohexyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
25 A-87	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -	
A-88	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CHCH <sub>2</sub> -	
A-89	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-90	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CHF(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-91	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CHFCH <sub>2</sub> -	
30 A-92	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-93	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-94	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-95	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	
35 A-96	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	
A-97	-CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -	
A-98	-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	
A-99	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	

40

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Phycomyceten* und *Basidiomyceten*,

45 aus. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- 10 • *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
  - *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
  - *Cercospora arachidicola* an Erdnüssen,
  - *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- 15 • *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
  - *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
  - *Helminthosporium*-Arten an Getreide,
  - *Mycosphaerella*-Arten an Bananen und Erdnüssen,
- 20 • *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
  - *Plasmopara viticola* an Reben,
  - *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
  - *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
  - *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- 25 • *Puccinia*-Arten an Getreide,
  - *Pyricularia oryzae* an Reis,
  - *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
  - *Septoria nodorum* an Weizen,
  - *Uncinula necator* an Reben,
- 30 • *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
  - *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.



Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

- 5 Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

- 10 Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effektes. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

- 15 Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

- Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon), Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nicht-ionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

- Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykoether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxy-

liertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenol-polyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser, in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind:

I. 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

- II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).
- III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).
- IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).
- V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-alpha-sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).
- VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl-alpha-pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).
- VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-alpha-sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Lignin-

sulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitete werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden; wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen

I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

- 5 Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:
- Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyldithiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbis-
  - 10 dithiocarbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-Zink-ethylen-diamin-bis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide, Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat), Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), Zink-(N,N'-propylenbis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylen-
  - 15 bis-(thiocarbamoyl)disulfid;
  - Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat, 5-Nitro-isophthalsäure-di-isopropylester;
  - 20 • heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat, 2-Chlor-N-(4'-chlor-biphenyl-2-yl)-nicotinamid, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, O,O-Diethyl-phthalimidophosphonothioat, 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)-phosphinyl]-3-phenyl-1,2,4-triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon,
  - 25 2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]chinoxalin, 1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester, 2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol, 2-(Furyl-(2))-benzimidazol, 2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-phthalimid,
  - 30 • N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäurediamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodanmethylthiobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazon, Pyridin-2-
  - 35 thio-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,4,5-Trime-
  - 40 thyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäureamid, 2-Methyl-benzoesäure-anilid, 2-Iod-benzoesäure-anilid, N-Formyl-N-morpholin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-diylbis-1-(2,2,2-trichlorethyl)-formamid,
  - 45 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan, 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw. dessen Salze, N-[3-(p-tert.-

- Butylphenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethyl-morpholin,  
N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-piperidin, 8-tert.-  
Butyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-ylmethyl(ethyl)(propyl)amin,  
1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-  
5 ethyl]-1H-1,2,4-triazol, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-pro-  
pyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Pro-  
pyl)-N-(2,4,6-trichlorphenoxyethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff,  
1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-bu-  
tanon, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-tria-  
10 zol-1-yl)-2-butanol, (2RS,3RS)-1-[3-(2-Chlorphenyl)-2-(4-fluor-  
phenyl)-oxiran-2-ylmethyl]-1H-1,2,4-triazol,  
(RS)-2-[2-(1-Chlorcyclopropyl)-3-(2-chlorphenyl)-2-hydroxypro-  
pyl]-2,4-dihydro-1,2,4-triazol-3-thion,  $\alpha$ -(4-Chlorphe-  
nyl)- $\alpha$ -(1-cyclopropylethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  
15  $\alpha$ -(2-Chlorphenyl)- $\alpha$ -(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol, 5-Bu-  
tyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-chlor-  
phenyl)-3-pyridinmethanol, 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thio-  
ureido)-benzol, 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-ben-  
zol,  
20 • Strobilurine wie Methyl-E-methoxyimino-[ $\alpha$ -(o-tolyloxy)-o-to-  
lyl]acetat, Methyl-E-2-[2-[6-(2-cyanophenoxy)-pyrimidin-4-  
yloxy]-phenyl]-3-methoxyacrylat, Methyl-E-methoxyimino-[ $\alpha$ -  
(2-phenoxyphenyl)]-acetamid, Methyl-E-methoxyimino-[ $\alpha$ -(2,5-di-  
methylphenoxy)-o-tolyl]-acetamid, Methyl-E-2-[2-[2-trifluorme-  
25 thylpyridyl-6-]oxymethyl]-phenyl]-3-methoxyacrylat, (E,E)-Metho-  
ximino-{2-[1-(3-trifluormethylphenyl)-ethylidenaminoxyme-  
thyl]-phenyl}-essigsäuremethylester, Methyl-N-(2-[1-(4-chlor-  
phenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxymethyl)-phenyl-N-methoxy-carbammat,  
• Anilinopyrimidine wie N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-anilin,  
30 N-[4-Methyl-6-(1-propinyl)-pyrimidin-2-yl]-anilin, N-[4-Me-  
thyl-6-cyclopropyl-pyrimidin-2-yl]-anilin,  
• Phenylpyrrole wie 4-(2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-pyr-  
rol-3-carbonitril,  
• Zimtsäureamide wie 3-(4-Chlorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphe-  
35 nyl)-acrylsäuremorpholid und 3-(4-Fluorphenyl)-3-(3,4-dimetho-  
xyphenyl)-acrylsäuremorpholid,  
• sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat,  
1-(3-Brom-6-methoxy-2-methyl-phenyl)-1-(2,3,4-trimethoxy-6-me-  
thyl-phenyl)-methanon, 3-[3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-  
40 hydroxyethyl]-glutarimid, Hexachlorbenzol, DL-Methyl-N-(2,6-di-  
methyl-phenyl)-N-furoyl(2)-alaninat, DL-N-(2,6-Dimethyl-phe-  
nyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-alanin-methyl-ester, N-(2,6-Dimethyl-  
phenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-aminobutyrolacton, DL-N-(2,6-Dime-  
thylphenyl)-N-(phenylacetyl)-alaninmethylester, 5-Methyl-5-vi-  
45 nyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin, 3-(3,5-Di-  
chlorphenyl)-5-methyl-5-methoxymethyl-1,3-oxazolidin- 2,4-dion,  
3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-isopropylcarbamoylethylhydantoin, N-(3,5-Di-

40

chlorphenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-1,2-dicarbonsäureimid,  
2-Cyano-[N-(ethylaminocarbo-nyl)-2-methoximino]-acetamid,  
1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-pen-tyl]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-Di-  
fluor-a-(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)-benzhydrylalkohol,  
5 N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-5-trifluorme-  
thyl-3-chlor-2-aminopyridin, 1-((bis-(4-Fluorphenyl)-methylsi-  
lyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol, 5-Chlor-2-cyano-4-p-tolyl-imida-  
zol-1-sulfonsäuredimethylamid, 3,5-Dichlor-N-(3-chlor-1-ethyl-  
1-methyl-2-oxo-propyl)-4-methyl-benzamid, Isopropyl-2-me-  
10 thyl-1-[(1-p-tolyloethyl)carbamoyl]-(S)-propylcarbammat,  
[(S)-1-[(1R)-1-(6-Fluor-1,3-benzothiazol-2-yl)ethyl]carb-  
amoyl]-2-methylpropyl]carbaminsäure, 6-Iod-2-propoxy-3-propyl-  
chinazolin-4(3H)-on.

15

20

25

30

35

40

45

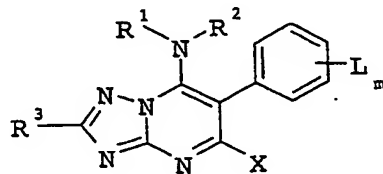
2-Substituierte Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

5

### Zusammenfassung

2-Substituierte Triazolopyrimidine der Formel I,

10



15 in die Substituenten folgende Bedeutung haben:

L Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Halogenalkoxy,  $-C(=O)-A$  oder  $S(=O)_nA'$ ;

20

A und A' gemäß der Beschreibung definiert sind;  
n 0, 1 oder 2; m 0 oder 1, 2, 3, 4 oder 5 bedeuten;

X Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy oder Halogenalkoxy;

25

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Halogenocycloalkyl, Alkenyl, Alkadienyl, Halogenalkenyl, Cycloalkenyl, Alkynyl, Halogenalkynyl oder Cycloalkynyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein,

30

35

wobei R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> gemäß der Beschreibung substituiert sein können; und

40

R<sup>3</sup> Cyano, Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy oder NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>;

Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser  
45 Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.